(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum Internationales Büro





(43) Internationales Veröffentlichungsdatum 15. Januar 2004 (15.01.2004)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer WO 2004/004713 A1

- (51) Internationale Patentklassifikation⁷: A61K 31/438. C07D 221/20, A61P 37/06, 35/00, 33/00
- (21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2003/007427
- (22) Internationales Anmeldedatum:

9. Juli 2003 (09.07.2003)

(25) Einreichungssprache:

Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache:

Deutsch

(30) Angaben zur Priorität: 102 30 917.5

9. Juli 2002 (09.07.2002) DE

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US): BIOFRONTERA PHARMACEUTICALS HOLD-ING AG [DE/DE]; Hemmelrather Weg 201, 51377 Leverkusen (DE).

- (72) Erfinder; und
- (75) Erfinder/Anmelder (nur für US): SIMON, Werner [DE/DE]: In der Leihwiese 29, 55595 Hüffelsheim (DE). ABEL, Ulrich [DE/DE]: Angelweg 2, 69121 Heidelberg (DE).
- (74) Anwalt: DREISS, FUHLENDORF, STEIMLE & BECKER; Gerokstrasse 1, 70188 Stuttgart (DE).
- (81) Bestimmungsstaaten (national): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, Fl, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

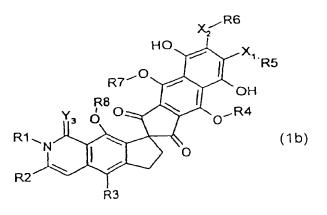
[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

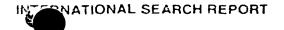
- (54) Title: FREDERICAMYCIN DERIVATIVES AS MEDICAMENTS FOR TREATING TUMOURS
- (54) Bezeichnung: FREDERICAMYCIN-DERIVATE ALS ARZNEIMITTEL ZUR TUMORBEHANDLUNG

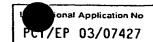
$$R7$$
 X_2
 $R6$
 X_1
 $R5$
 $R8$
 O
 O
 $R4$
 $R1$
 $R2$
 $R3$
 $R8$
 O
 O
 $R4$
 O
 $R4$
 O
 O
 O

- (57) Abstract: The invention relates to novel fredericamycin derivatives of general formula (la) or (lb), to medicaments containing said derivatives or the salts of the same, and to the use of said fredericamycin derivatives for treating diseases, especially tumour diseases.
- (57) Zusammenfassung: Die Erfindung betrifft neue Fredericamycin-Derivate gemäss allgemeiner Formel (la) oder (lb) Arzneimittel die diese oder deren Salze enthalten, und die Verwendung der Fredericamycin-Derivate zur Behandlung von Erkrankungen, insbesondere Tumorerkrankungen.









A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
IPC 7 A61K31/438 C07D221/20 A61P37/06 A61

A61P35/00

A61P33/00

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED.

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) IPC 7 C07D

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

EPO-Internal, WPI Data, BEILSTEIN Data, CHEM ABS Data

			Relevant to state \$10
Category °	Citation of document, with indication, where appropriate, of	the relevant passages	Relevant to claim No.
A	US 5 166 208 A (KELLY THOMAS 24 November 1992 (1992-11-24) cited in the application shema V claims; examples 83-148,150;		1-11
A	US 4 584 377 A (ISHIZEKI SEIJ 22 April 1986 (1986-04-22) cited in the application column 4, line 66 -column 7, claims		1-11
A	US 4 673 678 A (MISRA RENUKA) 16 June 1987 (1987-06-16) cited in the application column 6, line 65 -column 10, claims	line 68;	1-11
X Fur	ther documents are listed in the continuation of box C.	X Patent family members are	listed in annex.
"A" docum consi "E" earlier filing "L" docum which citati "O" docum other "P" docum	ategories of cited documents: ment defining the general state of the art which is not idered to be of particular relevance document but published on or after the international date ent which may throw doubts on priority claim(s) or his cited to establish the publication date of another on or other special reason (as specified) ment referring to an oral disclosure, use, exhibition or rimeans entitle prior to the international filing date but than the priority date claimed	"T" later document published after the or priority date and not in conflicted to understand the principle invention. "X" document of particular relevance cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when "Y" document of particular relevance cannot be considered to involve document is combined with one ments, such combination being in the art. "8" document member of the same of	t with the application but or theory underlying the ; the claimed invention cannot be considered to the document is taken alone ; the claimed invention an inventive step when the or more other such docupobious to a person skilled
	e actual completion of the international search	Date of mailing of the internation	nal search report
	17 October 2003	31/10/2003	
Name and	f mailing address of the ISA European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl, Fax: (+31-70) 340-3016	. Authorized officer . Gavriliu, D	



In	Application No	
PCT/EP	03/07427	

Patent document cited in search report	j	Publication date		Patent family member(s)	Publication date
US 5166208	Α	24-11-1992	NONE		
US 4584377	Α	22-04-1986	JP	1019386 B	11-04-1989
			JP	1534258 C	12-12-1989
			JP	60042368 A	06-03-1985
			JP	1049267 B	24-10-1989
			JP	1560318 C	31-05-1990
			JP	60056960 A	02-04-1985
į.		•	JP	1049268 B	24-10-1989
			JP	1560319 C	31-05-1990
• • •			JP	60058964 A	05-04-1985
•			CA	1267147 A1	27-03-1990
			CH	669379 A5	15-03-1989
			DE	3430365 A1	07-03-1985
			FR	2550791 A1	22-02-1985
			GB	2145084 A ,B	20-03-1985
	<u> </u>		IT.	1177967 B	03-09-1987
US 4673678	Α	16-06-1987	NONE		





KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES PK 7 A61K31/438 C07D221/20 A61P33/00 A61P35/00 A61P37/06 Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der iPK **B. RECHERCHIERTE GEBIETE** Recherchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole) IPK 7 CO7D Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe) EPO-Internal, WPI Data, BEILSTEIN Data, CHEM ABS Data C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN Betr. Anspruch Nr. Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile US 5 166 208 A (KELLY THOMAS R ET AL) 1-11 Α 24. November 1992 (1992-11-24) in der Anmeldung erwähnt shema V Ansprüche; Beispiele 83-148,150; Tabelle US 4 584 377 A (ISHIZEKI SEIJI ET AL) 1-11 Α 22. April 1986 (1986-04-22) in der Anmeldung erwähnt Spalte 4, Zeile 66 -Spalte 7, Zeile 44; Ansprüche 1-11 US 4 673 678 A (MISRA RENUKA) A 16. Juni 1987 (1987-06-16) in der Anmeldung erwähnt Spalte 6, Zeile 65 -Spalte 10, Zeile 68; Ansprüche Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu Siehe Anhang Patentfamilie * Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen *A* Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist

"E" älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröllentlicht worden ist

L Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhalt er-scheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)

O Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung,

eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist

- T* Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist
- Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erlindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erlinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden

Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erlindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit berühend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist

& Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Absendedatum des internationalen Recherchenberichts

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

17. Oktober 2003

31/10/2003

Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde

Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentiaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl, Fax: (+31-70) 340-3016

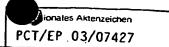
Bevollmächtigter Bediensteter

Gavriliu, D

MITERNATIONAL Angaben zu Veröffentlich

RECHERCHENBERICHT

, die zur selben Patentlamilie gehören



Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument		Datum der Veröffentlichung		Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
US 5166208	Α	24-11-1992	KEINE		
US 4584377	Α	22-04-1986	JP	1019386 B	11-04 3000
			JP	1534258 C	11-04-1989
			ĴΡ	60042368 A	12-12-1989
			JP		06-03-1985
				1049267 B	24-10-1989
•			JP	1560318 C	31-05-1990
			JP	60056960 A	02-04-1985
•		•	JP	1049268 B	24-10-1989
			JP	1560319 C	31-05-1990
• •			JP	60058964 A	05-04-1985
•			CA	1267147 A1	27-03-1990
			, CH .	669379 A5	15-03-1989
			DE .	3430365 A1	07-03-1985
			FR	2550791 A1	
			GB	2145084 A ,B	22-02-1985
•			ĬŢ	1177967 B	20-03-1985
				11//3U/ D	03-09-1987
US 4673678	A	16-06-1987	KEINE		